

世界知的所有権機関
国際事務局

PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願



B5

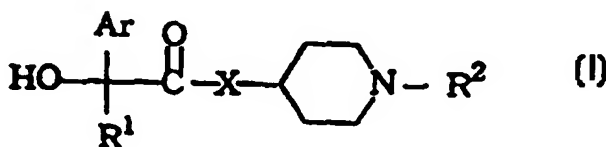
<p>(51) 国際特許分類6 C07D 211/58, 401/06, A61K 31/445 // (C07D 401/06, 211:00, 213:00)</p>	A1	<p>(11) 国際公開番号 WO97/45414</p> <p>(43) 国際公開日 1997年12月4日(04.12.97)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP97/01770</p> <p>(22) 国際出願日 1997年5月27日(27.05.97)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平8/159176 1996年5月31日(31.05.96)</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.)(JP/JP) 〒103 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者 ; および</p> <p>(75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ) 土谷義己(TSUCHIYA, Yoshimi)(JP/JP) 大沢浩一(OHSAWA, Hirokazu)(JP/JP) 川上久美子(KAWAKAMI, Kumiko)(JP/JP) 大脇健二(OHWAKI, Kenji)(JP/JP) 錦辺 優(NISHIKIBE, Masaru)(JP/JP) 〒300-26 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki, (JP) 野本貴史(NOMOTO, Takashi)(JP/JP) 〒360-02 埼玉県大里郡妻沼町大字西城810番地 萬有製薬株式会社 開発研究所内 Saitama, (JP)</p>	<p>(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ARIPO特許 (GH, KE, LS, MW, SD, SZ, UG), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>	

(54) Title: 1,4-DISUBSTITUTED PIPERIDINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称 1,4 ジ置換ピペリジン誘導体

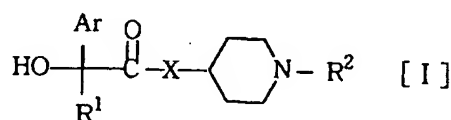
(57) Abstract

1,4-Disubstituted piperidine derivatives represented by general formula (I) and pharmaceutically acceptable salts thereof, wherein Ar represents heteroaryl having one or two heteroatoms selected from the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur and optionally fused to aryl or benzene (wherein each hydrogen on the aryl and heteroaryl rings may be substituted by lower alkyl, halogeno, lower alkoxy, amino or hydroxymethyl); R¹ represents C₁₋₄ cycloalkyl having one or two hydroxyl groups on the ring; R² represents heteroarylalkyl having one or two heteroatoms selected from the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur and optionally fused to saturated or unsaturated aliphatic C₃₋₁₅ hydrocarbon, aralkyl, arylalkenyl or benzene (wherein each hydrogen on the aralkyl, arylalkenyl and heteroarylalkyl rings may be substituted by lower alkyl, halogeno, lower alkoxy, amino or hydroxymethyl); and X represents O or NH. Because of having a selective muscarine M₁ receptor antagonism, these compounds are useful as safe remedies or preventives with little side effects for respiratory diseases such as asthma, chronic respiratory obstruction and pulmonary fibrosis; urologic diseases in association with urination disorders such as frequent urination, urgency of micturition and urinary incontinence; and digestive diseases such as irritable bowel syndrome and convulsion or motor hyperenergia of digestive tracts.



(57) 要約

本発明は、一般式 [I]



[式中、Arはアリール基又はベンゼン環と縮合していてもよい窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる1又は2個のヘテロ原子を有するヘテロアリール基（但し、アリール基及びヘテロアリール基の環上の水素原子は低級アルキル基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、アミノ基又はヒドロキシメチル基で置換されていてもよい）を表し、R¹は1～2個の水酸基を環上に有する炭素数3～6個のシクロアルキル基を表し、R²は炭素数5～15個の飽和又は不飽和の脂肪族炭化水素基、アラルキル基、アリールアルケニル基又はベンゼン環と縮合していてもよい窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる1又は2個のヘテロ原子を有するヘテロアリールアルキル基（但し、該アラルキル基、アリールアルケニル基及びヘテロアリールアルキル基の環上の水素原子は低級アルキル基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、アミノ基又はヒドロキシメチル基で置換されていてもよい）を表し、そしてXはO又はNHを表す]で示される1, 4-ジ置換ピペリジン誘導体及びその薬学的に許容されうる塩。

本発明の置換ヘテロ芳香環誘導体は選択的ムスカリンM₃受容体拮抗作用を有することにより、副作用が少なく安全で有効な、喘息、慢性気道閉塞及び肺繊維症等の呼吸器系疾患；頻尿、尿意切迫感及び尿失禁等の排尿障害を伴う泌尿器系疾患；過敏性大腸及び消化管の痙攣若しくは運動機能亢進等の消化器系疾患の治療又は予防剤として有用である。



参考情報

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に記載されたPCT加盟国を特定するために使用されるコード

AL	アルバニア	ES	スペイン	LR	リベリア	SG	シンガポール
AM	アルメニア	FJ	フィジー	LS	レソト	SI	スロヴェニア
AT	オーストリア	FR	フランス	LT	リトアニア	SK	スロヴァキア共和国
AU	オーストラリア	GA	ガボン	LU	ルクセンブルグ	SL	シエラレオネ
AZ	アゼルバイジャン	GB	英国	LV	ラトヴィア	SN	セネガル
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GE	グルジア	MC	モナコ	SZ	スワジランド
BB	バルバドス	GH	ガーナ	MD	モルドヴァ共和国	TD	チャード
BE	ベルギー	GM	ガンビア	MG	マダガスカル	TG	トーゴ
BF	ブルキナ・ファソ	GN	ギニア	MK	マケドニア共和国	TJ	タジキスタン
BG	ブルガリア	GR	ギリシャ		ラヴィア共和国	TM	トルクメニスタン
BJ	ベナン	HU	ハンガリー	ML	マリ	TR	トルコ
BR	ブラジル	ID	インドネシア	MN	モンゴル	TT	トリニダード・トバゴ
BY	ベラルーシ	IE	アイルランド	MR	モーリタニア	UA	ウクライナ
CA	カナダ	IL	イスラエル	MW	マラウイ	UG	ウガンダ
CF	中央アフリカ共和国	IS	アイスランド	MX	メキシコ	US	米国
CG	コンゴ	IT	イタリア	NE	ニジェール	UZ	ウズベキスタン
CH	スイス	JP	日本	NL	オランダ	VN	ヴェトナム
CI	コート・ジボワール	KE	ケニア	NO	ノルウェー	YU	ユーゴスラビア
CM	カメルーン	KG	キルギスタン	NZ	ニュージーランド	ZW	ジンバブウェ
CN	中国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	PL	ポーランド		
CU	キューバ	KR	大韓民国	PT	ポルトガル		
CZ	チェコ共和国	KZ	カザフスタン	RO	ルーマニア		
DE	ドイツ	LC	セントルシア	RU	ロシア連邦		
DK	デンマーク	LJ	リヒテンシュタイン	SD	スーダン		
EE	エストニア	LK	スリランカ	SE	スウェーデン		

Family list

2 family members for:

W09745414

Derived from 2 applications.

W English equivalent

- 1 **1,4-disubstituted piperidine derivatives**
Publication info: **AU2793197 A** - 1998-01-05
- 2 **1,4-DISUBSTITUTED PIPERIDINE DERIVATIVES**
Publication info: **W09745414 A1** - 1997-12-04

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

THIS PAGE BLANK (USP10)